

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005 年 4 月 21 日 (21.04.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/035538 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 499/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/015299

(22) 国際出願日: 2004 年 10 月 8 日 (08.10.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願 2003-352723  
2003 年 10 月 10 日 (10.10.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大塚化学株式会社 (OTSUKA CHEMICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5400021 大阪府大阪市中央区大手通 3 丁目 2 番 27 号 Osaka (JP). 大鵬薬品工業株式会社 (TAIHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町 1 丁目 27 番地 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 徳丸 祥久 (TOKUMARU, Yoshihisa) [JP/JP]; 〒7710193 徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3 大塚化学株式会社内 Tokushima (JP). 島林 昭裕 (SHIMABAYASHI, Akihiro) [JP/JP]; 〒7710193 徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3 大塚化学株式会社内 Tokushima (JP).

(74) 代理人: 三枝 英二, 外 (SAEGUSA, Eiji et al.); 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町 1-7-1 北浜 T N K ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告書
- 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PENAM CRYSTAL AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME

(54) 発明の名称: ペナム結晶及びその製造法

(57) Abstract: Novel 2  $\alpha$ -methyl-2  $\beta$ -[(1,2,3-triazol-1-yl)methyl]penam-3  $\alpha$ -carboxylic acid benzhydryl ester (TMPB)-acetone crystals for use in producing 2  $\alpha$ -methyl-2  $\beta$ -[(1,2,3-triazol-1-yl)methyl]penam-3  $\alpha$ -carboxylic acid 1,1-dioxide benzhydryl ester (TAZB); a process for producing TMPB-acetone crystals which comprises (A) the step of concentrating an organic solvent solution containing TMPB, (B) the step of dissolving the resultant concentrate in acetone, and (C) the step of crystallizing TMPB-acetone crystals from the acetone solution obtained; and a process for producing TAZB which comprises the step of reacting TMPB-acetone crystals with an oxidizing agent.

(57) 要約: 本発明は、2  $\alpha$ -メチル-2  $\beta$ -[(1, 2, 3-トリアゾール-1-イル) メチル]ペナム-3  $\alpha$ -カルボン酸 1, 1-ジオキシドベンズヒドリルエステル (TAZB) を製造するために用いられる新規な 2  $\alpha$ -メチル-2  $\beta$ -[(1, 2, 3-トリアゾール-1-イル) メチル]ペナム-3  $\alpha$ -カルボン酸ベンズヒドリルエステル (TMPB)-アセトン結晶; (A) TMPB を含む有機溶媒溶液を濃縮する工程、(B) 得られる濃縮物をアセトンに溶解する工程、及び (C) 得られるアセトン溶液から TMPB-アセトン結晶を晶析させる工程を含む TMPB-アセトン結晶の製造方法; 及び TMPB-アセトン結晶を酸化剤と反応させる工程を含む TAZB の製造方法を提供する。

WO 2005/035538 A1